

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005年2月17日 (17.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/014559 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 249/06, 271/06, 263/32, 413/12, 409/12, 413/14, 417/14, A61K 31/4192, 31/4245, 31/421, 31/541, 31/422, 31/382, 31/4439, 31/404, 31/427, 31/416, 31/541, A61P 31/22

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/011573

(22) 国際出願日: 2004年8月5日 (05.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-290850 2003年8月8日 (08.08.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 山之内製薬株式会社 (YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1038411 東京都中央区日本橋本町二丁目3番11号 Tokyo (JP). 株式会社創薬技術研究所 (RATIONAL DRUG DESIGN LABORATORIES) [JP/JP]; 〒1748612 東京都板橋区蓮根三丁目17番1号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 紺谷 徹 (KON-TANI, Toru) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 宮田 淳司 (MIYATA, Junji) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 濱口 渉 (HAMAGUCHI, Wataru) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 河野 友昭 (KAWANO, Tomoaki) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 神川 晃雄 (KAMIKAWA, Akio)

[JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 鈴木 弘 (SUZUKI, Hiroshi) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP). 周藤 健治 (SUDO, Kenji) [JP/JP]; 〒3058585 茨城県つくば市御幸が丘21山之内製薬株式会社内 Ibaraki (JP).

(74) 代理人: 森田 拓, 外 (MORITA, Hiroshi et al.); 〒1748612 東京都板橋区蓮根三丁目17番1号 山之内製薬株式会社 特許部内 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ユーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: AMIDE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: アミド誘導体

(57) Abstract: It is intended to provide novel a compound useful in drugs, in particular, in drugs for various diseases caused by infection with viruses belonging to the family *Herpesviridae*, i.e., in preventing or treating infections with various herpesviruses, more specifically speaking, chicken pox (varicella) caused by the infection with varicella-zoster virus, herpes zoster caused by recurrent infection with persistent varicella-zoster virus, labial herpes and herpes encephalitis caused by infection with HSV-1, genital herpes caused by infection with HSV-2, etc. An N-{2-[(4-substituted phenyl)amino]-2-oxoethyl}tetrahydro-2H-thiopyran-4-carboxamide derivative having a specific 5- or 6-membered hetroaryl substituent at the 4-position has a favorable antiviral activity and makes it possible to treat the above diseases by oral administration in a small dose.

(57) 要約: 医薬、殊にヘルペスウイルス科のウイルス感染に伴う各種疾患、具体的には、水痘帯状疱疹ウイルス感染に伴う水痘 (水疱瘡)、潜伏した水痘帯状疱疹ウイルスの回帰感染に伴う帯状疱疹、HSV-1感染に伴う口唇ヘルペスやヘルペス脳炎、HSV-2感染に伴う性器ヘルペス等の、各種ヘルペスウイルス感染症の予防もしくは治療に有用な新規化合物の提供。フェニル基の4位が特定の5~6員ヘテロアリアル基で置換されたN-[2-[(4-置換フェニル)アミノ]-2-オキソエチル]テトラヒドロ-2H-チオピラン-4-カルボキサミド誘導体は良好な抗ウイルス活性を有しており、低用量の経口投与により上記疾患の治療を可能とした。



WO 2005/014559 A1